

VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE KUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS

Absender: DIE MIT DER INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN  
PRÜFUNG BEAUFTRAGTE BEHÖRDE

PCT

An

e  
BASF AG  
Patentabteilung ZDX/A-C6  
D-67056 LUDWIGSHAFEN  
ALLEMAGNE  
Patentabteilung  
20. OKT. 1995

MITTEILUNG ÜBER DIE ÜBERSENDUNG  
DES INTERNATIONALEN VORLÄUFIGEN  
PRÜFUNGSBERICHTS

(Regel 71.1 PCT)

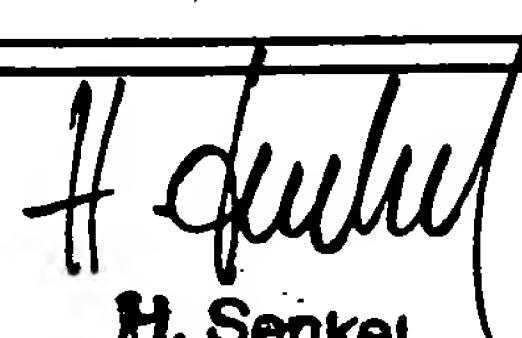
Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts 0050/44751	Absendedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>23. 10. 95</b>	
Internationales Aktenzeichen PCT/EP 95/ 01099	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) 23/03/1995	WICHTIGE MITTEILUNG
Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) 31/03/1994	Anmelder BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.	

- Dem Anmelder wird mitgeteilt, daß ihm die mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragte Behörde hiermit den zu der internationalen Anmeldung erstellten internationalen vorläufigen Prüfungsbericht, gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen, übermittelt.
- Eine Kopie des Berichts wird - gegebenenfalls mit den dazugehörigen Anlagen - dem Internationalen Büro zur Weiterleitung an alle ausgewählten Ämter übermittelt.
- Auf Wunsch eines ausgewählten Amtes wird das Internationale Büro eine Übersetzung des Berichts (jedoch nicht der Anlagen) ins Englische anfertigen und diesem Amt übermitteln.
- ERINNERUNG**

Zum Eintritt in die nationale Phase hat der Anmelder vor jedem ausgewählten Amt innerhalb von 30 Monaten ab dem Prioritätsdatum (oder in manchen Ämtern noch später) bestimmte Handlungen (Einreichung von Übersetzungen und Entrichtung nationaler Gebühren) vorzunehmen (Artikel 39 (1)) (siehe auch die durch das Internationale Büro mit Formblatt PCT/IB/301 übermittelte Information).

Ist einem ausgewählten Amt eine Übersetzung der internationalen Anmeldung zu übermitteln, so muß diese Übersetzung auch Übersetzungen aller Anlagen zum internationalen vorläufigen Prüfungsbericht enthalten. Es ist Aufgabe des Anmelders, solche Übersetzungen anzufertigen und den betroffenen ausgewählten Ämtern direkt zuzuleiten.

Weitere Einzelheiten zu dem maßgebenden Fristen und Erfordernissen der ausgewählten Ämter sind Band II des PCT-Leitfadens für Anmelder zu entnehmen.

Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. (+ 49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d Fax: (+ 49-89) 2399-4465	Bevollmächtigter Bediensteter Tel.   <b>H. Senkel</b>
--	--

**VERTRÄGE ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS**

**PCT**

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT**

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>0050/44751</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b>	siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/EP 95/01099</b>	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr) <b>23/03/1995</b>	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr) <b>31/03/1994</b>
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK <b>A61K31/00</b>		
Anmelder <b>BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.</b>		

1. Der internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 36 übermittelt.

2. Dieser **BERICHT** umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

Außerdem liegen dem Bericht **ANLAGEN** bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geänderte wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT)

Diese Anlagen umfassen insgesamt \_\_\_\_\_ Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben und die entsprechenden Seiten zu folgenden Punkten:

- I  Grundlage des Berichts
- II  Priorität
- III  Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erforderliche Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV  Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V  Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erforderlichen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI  Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII  Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII  Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags <b>21/08/1995</b>	Datum der Fertigstellung dieses Berichts <b>23. 10. 95</b>
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde   <b>Europäisches Patentamt D-80298 München</b> Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d Fax: (+49-89) 2399-4465	Bevollmächtigter Bediensteter   <b>K. Seegert</b> Tel. 2399-8403

## INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT

## I. Grundlage des Berichts

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten.)

der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung.

der Beschreibung, Seite/n \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
\_\_\_\_\_

der Ansprüche, Nr. \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Nr. \_\_\_\_\_, in der nach Artikel 19 geänderten Fassung.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
\_\_\_\_\_

der Zeichnungen, Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
\_\_\_\_\_

2. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

Beschreibung: Seite \_\_\_\_\_.  
 Ansprüche: Nr. \_\_\_\_\_.  
 Zeichnungen: Blatt/Abb. \_\_\_\_\_.

3.  Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

4. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

**V. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erläuterungen zur Stützung dieser Feststellung****1. FESTSTELLUNG**

Neuheit	Ansprüche 1 _____	JA
	Ansprüche _____	NEIN
Erfinderische Tätigkeit	Ansprüche 1 _____	JA
	Ansprüche _____	NEIN
Gewerbliche Anwendbarkeit	Ansprüche _____	JA
	Ansprüche _____	NEIN

**2. UNTERLAGEN UND ERLÄUTERUNGEN**

1. Das folgende im Recherchenbericht zitierte Dokument D1 ist in diesem Bericht berücksichtigt worden:

D1: EP-A-0 517 215

2. Der Gegenstand der vorliegenden Anmeldung betrifft bestimmte Pyrimidin- oder Triazincarbonsäurederivate zur Verwendung als Arzneimittel. Die therapeutische Verwendung beruht auf der endothelin-antagonistischen Wirkung dieser Verbindungen.
3. Die in Anspruch 1 genannten Verbindungen sind bisher lediglich als Herbizide genannt (siehe D1). Der Gegenstand des Anspruchs 1 ist somit neu im Sinne des Artikels 33 (2) PCT. Die Erfordernisse des Artikels 33 (3) PCT sind ebenfalls erfüllt, da sich aus dem Stand der Technik die Verwendung als Arzneimittel nicht in naheliegender Weise ableiten lässt.
4. Für die Beurteilung der Frage, ob der vorliegende An-

spruch gewerblich anwendbar ist, enthält der PCT keine einheitlichen Kriterien. Die Patentierbarkeit kann auch von der Formulierung der Ansprüche abhängen. Das EPA beispielsweise erkennt den Gegenstand der Ansprüche, die auf die medizinische Anwendung einer Verbindung gerichtet sind, nicht als gewerblich anwendbar an; es lässt jedoch Ansprüche zu, die auf eine bekannte Verbindung zur erstmaligen medizinischen Anwendung und die Verwendung einer solchen Verbindung zur Herstellung eines Arzneimittels für eine neue medizinische Anwendung gerichtet sind.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP95/01099

**VI. Bestimmte angeführte Unterlagen****1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)**

Anmeldenr.	Veröffentlichungsdatum (Tag/Monat/Jahr)	Anmelddatum (Tag/Monat/Jahr)	Prioritätsdatum (zu Recht beansprucht)
Patentnr.			(Tag/Monat/Jahr)
DE-A-4 313 412	27.10.94	23.04.93	

**2. Nicht-schriftliche Offenbarung (Regel 70.9)**

Art der nicht-schriftlichen Offenbarung	Datum der nicht-schriftlichen Offenbarung (Tag/Monat/Jahr)	Datum der schriftl. Offenbarung, die sich auf die nicht-schriftl. Offenbarung bezieht (Tag/Monat/Jahr)

20

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
AUF DEM GEBIET DES PATENTWESENS**

**PCT**

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT**

REC'D	25 OCT 1995
WIPO	PCT

(Artikel 36 und Regel 70 PCT)

Aktenzeichen des Annehmers oder Anwalts  0050/44751	WEITERES VORGEHEN	siehe Mitteilung über die Übersendung des internationalen vorläufigen Prüfungsberichts (Formblatt PCT/IPEA/416)
Internationales Aktenzeichen  PCT/EP 95/01099	Internationales Anmeldedatum (Tag/Monat/Jahr)  23/03/1995	Prioritätsdatum (Tag/Monat/Jahr)  31/03/1994
Internationale Patentklassifikation (IPK) oder nationale Klassifikation und IPK  A61K31/00		
Annehmer  BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

1. Der internationale vorläufige Prüfungsbericht wurde von der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde erstellt und wird dem Annehmer gemäß Artikel 36 übermittelt.

2. Dieser **BERICHT** umfaßt insgesamt 5 Blätter einschließlich dieses Deckblatts.

Außerdem liegen dem Bericht **ANLAGEN** bei; dabei handelt es sich um Blätter mit Beschreibungen, Ansprüchen und/oder Zeichnungen, die geänderte wurden und diesem Bericht zugrunde liegen, und/oder Blätter mit vor dieser Behörde vorgenommenen Berichtigungen (siehe Regel 70.16 und Abschnitt 607 der Verwaltungsrichtlinien zum PCT)

Diese Anlagen umfassen insgesamt \_\_\_\_\_ Blätter.

3. Dieser Bericht enthält Angaben und die entsprechenden Seiten zu folgenden Punkten:

- I  Grundlage des Berichts
- II  Priorität
- III  Keine Erstellung eines Gutachtens über Neuheit, erforderliche Tätigkeit und gewerbliche Anwendbarkeit
- IV  Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung
- V  Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erforderlichen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erklärungen zur Stützung dieser Feststellung
- VI  Bestimmte angeführte Unterlagen
- VII  Bestimmte Mängel der internationalen Anmeldung
- VIII  Bestimmte Bemerkungen zur internationalen Anmeldung

Datum der Einreichung des Antrags  21/08/1995	Datum der Fertigstellung dieses Berichts  23. 10. 95
Name und Postanschrift der mit der internationalen vorläufigen Prüfung beauftragten Behörde  Europäisches Patentamt D-80298 München Tel. (+49-89) 2399-0, Tx: 523656 epmu d Fax: (+49-89) 2399-4465	Bevollmächtigter Bediensteter  <i>Seegert</i> Tel. 2399-8403

## I. Grundlage des Berichts

1. Dieser Bericht wurde erstellt auf der Grundlage (Ersatzblätter, die dem Anmeldeamt auf eine Aufforderung nach Artikel 14 hin vorgelegt wurden, gelten im Rahmen dieses Berichts als "ursprünglich eingereicht" und sind ihm nicht beigefügt, weil sie keine Änderungen enthalten.)

der internationalen Anmeldung in der ursprünglich eingereichten Fassung.

der Beschreibung, Seite/n \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Seite/n \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
\_\_\_\_\_

der Ansprüche, Nr. \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Nr. \_\_\_\_\_, in der nach Artikel 19 geänderten Fassung.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Nr. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
\_\_\_\_\_

der Zeichnungen, Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, in der ursprünglich eingereichten Fassung.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit dem Antrag.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
Blatt/Abb. \_\_\_\_\_, eingereicht mit Schreiben vom \_\_\_\_\_.  
\_\_\_\_\_

## 2. Aufgrund der Änderungen sind folgende Unterlagen fortgefallen:

Beschreibung: Seite \_\_\_\_\_.  
 Ansprüche: Nr. \_\_\_\_\_.  
 Zeichnungen: Blatt/Abb. \_\_\_\_\_.

3.  Dieser Bericht ist ohne Berücksichtigung (von einigen) der Änderungen erstellt worden, da diese aus den angegebenen Gründen nach Auffassung der Behörde über den Offenbarungsgehalt in der ursprünglich eingereichten Fassung hinausgehen (Regel 70.2 c)).

## 4. Etwaige zusätzliche Bemerkungen:

v. Begründete Feststellung nach Artikel 35(2) hinsichtlich der Neuheit, der erfinderischen Tätigkeit und der gewerblichen Anwendbarkeit; Unterlagen und Erläuterungen zur Stützung dieser Feststellung

1. FESTSTELLUNG

Neuheit	Ansprüche 1	JA
	Ansprüche	NEIN
Erfinderische Tätigkeit	Ansprüche 1	JA
	Ansprüche	NEIN
Gewerbliche Anwendbarkeit	Ansprüche	JA
	Ansprüche	NEIN

2. UNTERLAGEN UND ERLÄUTERUNGEN

1. Das folgende im Recherchenbericht zitierte Dokument D1 ist in diesem Bericht berücksichtigt worden:

D1: EP-A-0 517 215

2. Der Gegenstand der vorliegenden Anmeldung betrifft bestimmte Pyrimidin- oder Triazincarbonsäurederivate zur Verwendung als Arzneimittel. Die therapeutische Verwendung beruht auf der endothelin-antagonistischen Wirkung dieser Verbindungen.

3. Die in Anspruch 1 genannten Verbindungen sind bisher lediglich als Herbizide genannt (siehe D1). Der Gegenstand des Anspruchs 1 ist somit neu im Sinne des Artikels 33 (2) PCT. Die Erfordernisse des Artikels 33 (3) PCT sind ebenfalls erfüllt, da sich aus dem Stand der Technik die Verwendung als Arzneimittel nicht in naheliegender Weise ableiten lässt.

4. Für die Beurteilung der Frage, ob der vorliegende An-

spruch gewerblich anwendbar ist, enthält der PCT keine einheitlichen Kriterien. Die Patentierbarkeit kann auch von der Formulierung der Ansprüche abhängen. Das EPA beispielsweise erkennt den Gegenstand der Ansprüche, die auf die medizinische Anwendung einer Verbindung gerichtet sind, nicht als gewerblich anwendbar an; es lässt jedoch Ansprüche zu, die auf eine bekannte Verbindung zur erstmaligen medizinischen Anwendung und die Verwendung einer solchen Verbindung zur Herstellung eines Arzneimittels für eine neue medizinische Anwendung gerichtet sind.

**INTERNATIONALER VORLÄUFIGER PRÜFUNGSBERICHT**

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP95/01099

**VI. Bestimmte angeführte Unterlagen****1. Bestimmte veröffentlichte Unterlagen (Regel 70.10)**

Anmeldenr.	Veröffentlichungsdatum	Anmeldedatum	Prioritätsdatum (zu Recht beansprucht)
Patentnr.	(Tag/Monat/Jahr)	(Tag/Monat/Jahr)	(Tag/Monat/Jahr)
DE-A-4 313 412	27.10.94	23.04.93	

**2. Nicht-schriftliche Offenbarung (Regel 70.9)**

Art der nicht-schriftlichen Offenbarung	Datum der nicht-schriftlichen Offenbarung (Tag/Monat/Jahr)	Datum der schriftl. Offenbarung, die sich auf die nicht-schriftl. Offenbarung bezieht (Tag/Monat/Jahr)

08/17/8377

500

aw

PCT/EP95/01099

# PATENT COOPERATION TREATY

PCT

## NOTIFICATION CONCERNING DOCUMENT TRANSMITTED

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

United States Patent and Trademark  
Office  
(Box PCT)  
Crystal Plaza 2  
Washington, DC 20231  
ETATS-UNIS D'AMERIQUE

in its capacity as elected Office

Date of mailing (day/month/year)  
18 October 1996 (18.10.96)

International application No.  
PCT/EP95/01099

International filing date (day/month/year)  
23 March 1995 (23.03.95)

Applicant  
BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al

The International Bureau transmits herewith the following documents and number thereof:

copy of the English translation of the international preliminary examination report (Article 36(3)(a))

The International Bureau of WIPO  
34, chemin des Colombettes  
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer

S. Mafla

Telephone No.: (41-22) 730.91.11

## PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION CONCERNING  
DOCUMENT TRANSMITTED

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

United States Patent and Trademark  
Office  
(Box PCT)  
Washington D.C. 20231  
United States of America

in its capacity as elected Office

Date of mailing (day/month/year) 30 October 1995 (30.10.95)	International application No. PCT/EP95/01099	International filing date (day/month/year) 23 March 1995 (23.03.95)
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al		

The International Bureau transmits herewith the following documents and number thereof:

copy of the international preliminary examination report (Article 36(3)(a))

The International Bureau of WIPO  
34, chemin des Colombettes  
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer

L. Panakal

Telephone No.: (41-22) 730.91.11

PATENT COOPERATION TREATY

PCT

NOTIFICATION OF ELECTION  
(PCT Rule 61.2)

From the INTERNATIONAL BUREAU

To:

United States Patent and Trademark  
Office  
(Box PCT)  
Washington D.C. 20231  
United States of America

in its capacity as elected Office

Date of mailing: 12 October 1995 (12.10.95)	
International application No.: PCT/EP95/01099	Applicant's or agent's file reference: 0050/44751
International filing date: 23 March 1995 (23.03.95)	Priority date: 31 March 1994 (31.03.94)
Applicant: BAUMANN, Ernst et al	

1. The designated Office is hereby notified of its election made:

in the demand filed with the International preliminary Examining Authority on:  
21 August 1995 (21.08.95)

in a notice effecting later election filed with the International Bureau on:  
\_\_\_\_\_

2. The election  was

was not

made before the expiration of 19 months from the priority date or, where Rule 32 applies, within the time limit under Rule 32.2(b).

The International Bureau of WIPO  
34, chemin des Colombettes  
1211 Geneva 20, Switzerland

Facsimile No.: (41-22) 740.14.35

Authorized officer:

J. Zahra  
Telephone No.: (41-22) 730.91.11

TRANSLATION  
PATENT COOPERATION TREATY

PCT

**INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT**

(PCT Article 36 and Rule 70)

Applicant's or agent's file reference  0050/44751	<b>FOR FURTHER ACTION</b> See Notification of Transmittal of International Preliminary Examination Report (Form PCT/IPEA/416)	
International application No. PCT/EP 95/01099	International filing date (day/month/year) 23/03/1995	Priority date (day/month/year) 31/03/1994
International Patent Classification (IPC) or national classification and IPC  A61K31/00		
Applicant BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.		

<p>1. This international preliminary examination report has been prepared by this International Preliminary Examining Authority and is transmitted to the applicant according to Article 36.</p> <p>2. This REPORT consists of a total of <u>5</u> sheets, including this cover sheet.</p> <p><input type="checkbox"/> This report is also accompanied by ANNEXES, i.e., sheets of the description, claims and/or drawings which have been amended and are the basis for this report and/or sheets containing rectifications made before this Authority (see Rule 70.16 and Section 607 of the Administrative Instructions under the PCT).</p> <p>These annexes consist of a total of _____ sheets.</p> <p>3. This report contains indications relating to the following items:</p> <ul style="list-style-type: none"> <li>I <input checked="" type="checkbox"/> Basis of the report</li> <li>II <input type="checkbox"/> Priority</li> <li>III <input type="checkbox"/> Non-establishment of opinion with regard to novelty, inventive step and industrial applicability</li> <li>IV <input type="checkbox"/> Lack of unity of the invention</li> <li>V <input checked="" type="checkbox"/> Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability: citations and explanations supporting such statement</li> <li>VI <input checked="" type="checkbox"/> Certain documents cited</li> <li>VII <input type="checkbox"/> Certain defects in the international application</li> <li>VIII <input type="checkbox"/> Certain observations on the international application</li> </ul>	
---	--

Date of submission of the demand  21/08/1995	Date of completion of this report  23.10.95
Name and mailing address of the IPEA/EP	Authorized officer
Facsimile No.	Telephone No.

## I. Basis of the report

1. This report has been drawn on the basis of (Replacement sheets which have been furnished to the receiving Office in response to an invitation under Article 14 are referred to in this report as "originally filed" and are not annexed to the report since they do not contain amendments.):

the international application as originally filed.

the description, pages \_\_\_\_\_, as originally filed.  
pages \_\_\_\_\_, filed with the demand.  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.  
pages \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.

the claims, Nos. \_\_\_\_\_, as originally filed.  
Nos. \_\_\_\_\_, as amended under Article 19.  
Nos. \_\_\_\_\_, filed with the demand.  
Nos. \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.  
Nos. \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.

the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_, as originally filed.  
sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the demand.  
sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.  
sheets/fig \_\_\_\_\_, filed with the letter of \_\_\_\_\_.

2. The amendments have resulted in the cancellation of:

the description, pages \_\_\_\_\_  
 the claims, Nos. \_\_\_\_\_  
 the drawings, sheets/fig \_\_\_\_\_

3.  This report has been established as if (some of) the amendments had not been made, since they have been considered to go beyond the disclosure as filed, as indicated in the Supplemental Box (Rule 70.2(c)).

4. Additional observations, if necessary:

**V. Reasoned statement under Article 35(2) with regard to novelty, inventive step or industrial applicability; citations and explanations supporting such statement****1. Statement**

Novelty (N)	Claims	1	YES
	Claims		NO
Inventive step (IS)	Claims	1	YES
	Claims		NO
Industrial applicability (IA)	Claims		YES
	Claims		NO

**2. Citations and explanations**

1. The following search report citation is considered in this report:

D1: EP-A-0 517 215.

2. The subject matter of the present application concerns specific pyrimidine or triazine carboxylic acid derivatives to be used as medicaments. The therapeutic use is based on the endothelin-antagonistic effect of these compounds.

3. The compounds cited in claim 1 have hitherto only been mentioned as herbicides (cf. D1). Therefore the subject matter of claim 1 is novel in the sense of PCT Article 33(2). The requirements of PCT Article 33(3) are likewise satisfied since the use as a medicament is not obvious from the prior art.

4. The PCT contains no uniform criteria for assessing the industrial applicability of the present application. Patentability may also depend on the wording of the claims. The EPO does not, for

**INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT**International application No.  
PCT/EP 95/01099

example, recognize the industrial applicability of claims to the use of a compound in a medical treatment; it does, however, allow claims to the first use of a known compound in a medical treatment or to the use of such a compound to manufacture a drug for a new medical treatment.

**INTERNATIONAL PRELIMINARY EXAMINATION REPORT**

International application No.

PCT/EP95/01099

**VI. Certain documents cited****1. Certain published documents (Rule 70.10)**

Application No. Patent No.	Publication date (day/month/year)	Filing date (day/month/year)	Priority date (valid claim) (day/month/year)
-------------------------------	--------------------------------------	---------------------------------	---

DE-A-4 313 412	27.10.94	23.04.93	
----------------	----------	----------	--

**2. Non-written disclosures (Rule 70.9)**

Kind of non-written disclosure

Date of non-written disclosure  
(day/month/year)Date of written disclosure  
referring to non-written disclosure  
(day/month/year)

**INTERNATIONAL SEARCH REPORT**

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 95/01099

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
DE-A-4313412	27-10-94	AU-B-	6568194	21-11-94
		WO-A-	9425442	10-11-94
-----	-----	-----	-----	-----
EP-A-0517215	09-12-92	JP-A-	4360887	14-12-92
		CN-A-	1067651	06-01-93
		US-A-	5387575	07-02-95
		JP-A-	5148242	15-06-93
		JP-A-	5148245	15-06-93
		JP-A-	5208962	20-08-93
-----	-----	-----	-----	-----

# INTERNATIONAL SEARCH REPORT

International Application No  
PCT/EP 95/01099

**A. CLASSIFICATION OF SUBJECT MATTER**  
IPC 6 A61K31/00 A61K31/505 A61K31/53

According to International Patent Classification (IPC) or to both national classification and IPC

**B. FIELDS SEARCHED**

Minimum documentation searched (classification system followed by classification symbols)

IPC 6 A61K

Documentation searched other than minimum documentation to the extent that such documents are included in the fields searched

Electronic data base consulted during the international search (name of data base and, where practical, search terms used)

**C. DOCUMENTS CONSIDERED TO BE RELEVANT**

Category *	Citation of document, with indication, where appropriate, of the relevant passages	Relevant to claim No.
P,A	DE,A,43 13 412 (BASF AG) 27 October 1994 see the whole document ---	1
A	EP,A,0 517 215 (UBE INDUSTRIES, LTD.) 9 December 1992 see the whole document -----	1

Further documents are listed in the continuation of box C.

Patent family members are listed in annex.

\* Special categories of cited documents :

- \*A\* document defining the general state of the art which is not considered to be of particular relevance
- \*E\* earlier document but published on or after the international filing date
- \*L\* document which may throw doubts on priority claim(s) or which is cited to establish the publication date of another citation or other special reason (as specified)
- \*O\* document referring to an oral disclosure, use, exhibition or other means
- \*P\* document published prior to the international filing date but later than the priority date claimed

- \*T\* later document published after the international filing date or priority date and not in conflict with the application but cited to understand the principle or theory underlying the invention
- \*X\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered novel or cannot be considered to involve an inventive step when the document is taken alone
- \*Y\* document of particular relevance; the claimed invention cannot be considered to involve an inventive step when the document is combined with one or more other such documents, such combination being obvious to a person skilled in the art.
- \*&\* document member of the same patent family

Date of the actual completion of the international search

6 July 1995

Date of mailing of the international search report

- 9. 08. 95

Name and mailing address of the ISA

European Patent Office, P.B. 5818 Patentlaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl.  
Fax (+ 31-70) 340-3016

Authorized officer

Seegert, K

**VERTRAG ÜBER DIE INTERNATIONALE ZUSAMMENARBEIT  
IM GEBIET DES PATENTVÖLKESENS**

**PCT**

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

(Artikel 18 sowie Regeln 43 und 44 PCT)

Aktenzeichen des Anmelders oder Anwalts <b>0050/44751</b>	<b>WEITERES VORGEHEN</b>	siehe Mitteilung über die Übermittlung des internationalen Recherchenberichts (Formblatt PCT/ISA/220) sowie, soweit zutreffend, nachstehender Punkt 5
Internationales Aktenzeichen <b>PCT/ EP 95/ 01099</b>	Internationales Anmeldedatum ( <i>Tag/Monat/Jahr</i> ) <b>23/03/95</b>	(Frühestes) Prioritätsdatum ( <i>Tag/Monat/Jahr</i> ) <b>31/03/94</b>

Anmelder

**BASF AKTIENGESELLSCHAFT et al.**

Dieser internationale Recherchenbericht wurde von der Internationalen Recherchenbehörde erstellt und wird dem Anmelder gemäß Artikel 18 übermittelt. Eine Kopie wird dem Internationalen Büro übermittelt.

Dieser internationale Recherchenbericht umfaßt insgesamt 3 Blätter.

Darüber hinaus liegt ihm jeweils eine Kopie der in diesem Bericht genannten Unterlagen zum Stand der Technik bei.

1.  Bestimmte Ansprüche haben sich als nicht recherchierbar erwiesen (siehe Feld I).
2.  Mangelnde Einheitlichkeit der Erfindung (siehe Feld II).
3.  In der internationalen Anmeldung ist ein Protokoll einer Nucleotid- und/oder Aminosäuresequenz offenbart; die internationale Recherche wurde auf der Grundlage des Sequenzprotokolls durchgeführt,
  - das zusammen mit der internationalen Anmeldung eingereicht wurde.
  - das vom Anmelder getrennt von der internationalen Anmeldung vorgelegt wurde,
    - dem jedoch keine Erklärung beigefügt war, daß der Inhalt des Protokolls nicht über den Offenbarungsgehalt der internationalen Anmeldung in der eingereichten Fassung hinausgeht.
  - das von der Internationalen Recherchenbehörde in die ordnungsgemäße Form übertragen wurde.
4. Hinsichtlich der Bezeichnung der Erfindung
  - wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.
  - wurde der Wortlaut von der Behörde wie folgt festgesetzt.

**PYRIMIDIN- ODER TRIZINCARBONSÄUREDERIVATE ZUR VERWENDUNG ALS ARZNEIMITTEL**

5. Hinsichtlich der Zusammenfassung

- wird der vom Anmelder eingereichte Wortlaut genehmigt.
- wurde der Wortlaut nach Regel 38.2b) in der Feld III angegebenen Fassung von dieser Behörde festgesetzt. Der Anmelder kann der Internationalen Recherchenbehörde innerhalb eines Monats nach dem Datum der Absendung dieses internationalen Recherchenberichts eine Stellungnahme vorlegen.

6. Folgende Abbildung der Zeichnungen ist mit der Zusammenfassung zu veröffentlichen:

Abb. Nr. \_\_\_\_\_

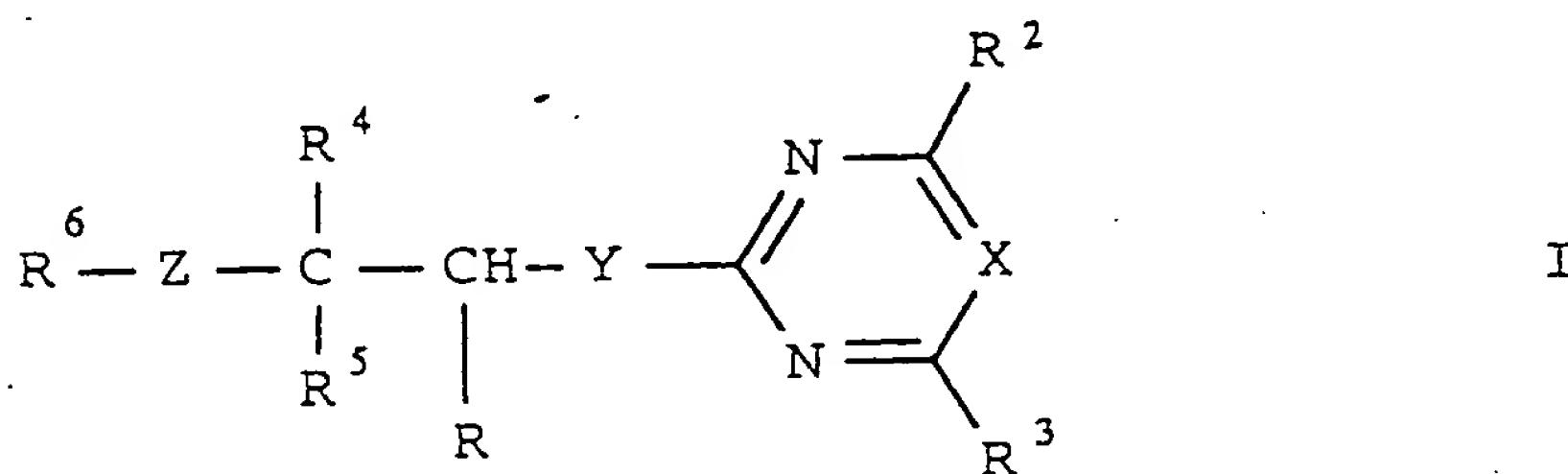
- wie vom Anmelder vorgeschlagen
- weil der Anmelder selbst keine Abbildung vorgeschlagen hat.
- weil diese Abbildung die Erfindung besser kennzeichnet.

keine der Abb.

Feld III

WORTLAUT DER ZUSAMMENFASSUNG (Fortsetzung von Punkt 5 auf Blatt 1)

Verwendung von Carbonsäurederivaten der Formel I



in der R eine Formylgruppe, eine Gruppe  $\text{CO}_2\text{H}$  oder einen zu  $\text{COOH}$  hydrolysierbaren Rest bedeutet:

- X Stickstoff oder  $\text{CR}^{14}$  bedeutet, wobei  $\text{R}^{14}$  Wasserstoff bedeutet oder zusammen mit  $\text{R}^3$  eine 3- bis 4-gliedrige Alkylen- oder Alkenylenkette bildet, in der jeweils eine Methylgruppe durch Sauerstoff ersetzt ist;
- Y Schwefel oder Sauerstoff oder eine Einfachbindung bedeutet;
- Z Schwefel oder Sauerstoff bedeutet; und die anderen Substituenten die in der Beschreibung angegebene Bedeutung haben zur Herstellung von Arzneimitteln.

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

P. EP 95/01099

A. Klassifizierung des Anmeldungsgegenstandes  
IPK 6 A61K31/00 A61K31/505 A61K31/53

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)

IPK 6 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P,A	DE,A,43 13 412 (BASF AG) 27.Oktober 1994 siehe das ganze Dokument ---	1
A	EP,A,0 517 215 (UBE INDUSTRIES, LTD.) 9.Dezember 1992 siehe das ganze Dokument -----	1

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentsfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- "A" Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- "E" älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- "L" Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- "O" Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- "P" Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

- "T" Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- "X" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- "Y" Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- "&" Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentsfamilie ist

1

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche	Absendedatum des internationalen Recherchenberichts
6.Juli 1995	- 9. 08. 95

Name und Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax: (+ 31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter  
Seegert, K

## INTERNATIONAL SEARCH REPORT

Information on patent family members

International Application No

PCT/EP 95/01099

Patent document cited in search report	Publication date	Patent family member(s)		Publication date
DE-A-4313412	27-10-94	AU-B-	6568194	21-11-94
		WO-A-	9425442	10-11-94
EP-A-0517215	09-12-92	JP-A-	4360887	14-12-92
		CN-A-	1067651	06-01-93
		US-A-	5387575	07-02-95
		JP-A-	5148242	15-06-93
		JP-A-	5148245	15-06-93
		JP-A-	5208962	20-08-93

# INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT

Internationales Aktenzeichen

PCT/EP 95/01099

A. Klassifizierung des Anmeldungsgegenstandes  
IPK 6 A61K31/00 A61K31/505 A61K31/53

Nach der Internationalen Patentklassifikation (IPK) oder nach der nationalen Klassifikation und der IPK

## B. RECHERCHIERTE GEBIETE

Recherchierte Mindestprüfstoff (Klassifikationssystem und Klassifikationssymbole)  
IPK 6 A61K

Recherchierte aber nicht zum Mindestprüfstoff gehörende Veröffentlichungen, soweit diese unter die recherchierten Gebiete fallen

Während der internationalen Recherche konsultierte elektronische Datenbank (Name der Datenbank und evtl. verwendete Suchbegriffe)

## C. ALS WESENTLICH ANGESEHENE UNTERLAGEN

Kategorie*	Bezeichnung der Veröffentlichung, soweit erforderlich unter Angabe der in Betracht kommenden Teile	Betr. Anspruch Nr.
P, A	DE,A,43 13 412 (BASF AG) 27.Oktober 1994 siehe das ganze Dokument ---	1
A	EP,A,0 517 215 (UBE INDUSTRIES, LTD.) 9.Dezember 1992 siehe das ganze Dokument -----	1

Weitere Veröffentlichungen sind der Fortsetzung von Feld C zu entnehmen

Siehe Anhang Patentfamilie

- \* Besondere Kategorien von angegebenen Veröffentlichungen :
- \* A\* Veröffentlichung, die den allgemeinen Stand der Technik definiert, aber nicht als besonders bedeutsam anzusehen ist
- \* E\* älteres Dokument, das jedoch erst am oder nach dem internationalen Anmeldedatum veröffentlicht worden ist
- \* L\* Veröffentlichung, die geeignet ist, einen Prioritätsanspruch zweifelhaft erscheinen zu lassen, oder durch die das Veröffentlichungsdatum einer anderen im Recherchenbericht genannten Veröffentlichung belegt werden soll oder die aus einem anderen besonderen Grund angegeben ist (wie ausgeführt)
- \* O\* Veröffentlichung, die sich auf eine mündliche Offenbarung, eine Benutzung, eine Ausstellung oder andere Maßnahmen bezieht
- \* P\* Veröffentlichung, die vor dem internationalen Anmeldedatum, aber nach dem beanspruchten Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist

- \* T\* Spätere Veröffentlichung, die nach dem internationalen Anmeldedatum oder dem Prioritätsdatum veröffentlicht worden ist und mit der Anmeldung nicht kollidiert, sondern nur zum Verständnis des der Erfindung zugrundeliegenden Prinzips oder der ihr zugrundeliegenden Theorie angegeben ist
- \* X\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann allein aufgrund dieser Veröffentlichung nicht als neu oder auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden
- \* Y\* Veröffentlichung von besonderer Bedeutung; die beanspruchte Erfindung kann nicht als auf erforderlicher Tätigkeit beruhend betrachtet werden, wenn die Veröffentlichung mit einer oder mehreren anderen Veröffentlichungen dieser Kategorie in Verbindung gebracht wird und diese Verbindung für einen Fachmann naheliegend ist
- \* &\* Veröffentlichung, die Mitglied derselben Patentfamilie ist

Datum des Abschlusses der internationalen Recherche

6.Juli 1995

Absendedatum des internationalen Recherchenberichts

- 9.08.95

Name und Postanschrift der Internationale Recherchenbehörde  
Europäisches Patentamt, P.B. 5818 Patentaan 2  
NL - 2280 HV Rijswijk  
Tel. (+ 31-70) 340-2040, Tx. 31 651 epo nl,  
Fax (+ 31-70) 340-3016

Bevollmächtigter Bediensteter

Seegert, K

**INTERNATIONALER RECHERCHENBERICHT**

Angaben zu Veröffentlichungen

die zur selben Patentfamilie gehören

Internationales Aktenzeichen

PS EP 95/01099

Im Recherchenbericht angeführtes Patentdokument	Datum der Veröffentlichung	Mitglied(er) der Patentfamilie		Datum der Veröffentlichung
DE-A-4313412	27-10-94	AU-B-	6568194	21-11-94
		WO-A-	9425442	10-11-94
EP-A-0517215	09-12-92	JP-A-	4360887	14-12-92
		CN-A-	1067651	06-01-93
		US-A-	5387575	07-02-95
		JP-A-	5148242	15-06-93
		JP-A-	5148245	15-06-93
		JP-A-	5208962	20-08-93